

EZÜST 12A10 BE 18時07分

ASAMURA 81-332705076

NO. 3213 P. 3

Béjelentés ügyszáma: P920

Közzétételi szám: 62565

Lajstromszám: Patent-Nr. 217809

Elsőbbségi adatok:

NSZO:

Áraj. dátum

Bejelentés napja:

19920317

Közzététel napja:

19930528

Megadás napja:

20000128

Megadás meghírítése:

20000428

DEP4108824.7 - 19910318

C07D-213/81; C07D-295/192; A61K-031/44; A61K-031/535

(1) P.1

Magyar cím:

Piridin-2,4-dikarbonsav-diimidök és ezeket tartalmazó gyógyszerkészítmények, és eljárás előállításukra

Angol cím:

PYRIDINE-2,4-DICARBOXYLIC ACID DIIMIDES, PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING THE SAME AND PROCESS FOR PRODUCING THEM

Bejelentő:

Hoechst Ag., Frankfurt/Main, DE

Feltaláló:

dr. Baader, Ekkehard, Königstein/Taunus, DE

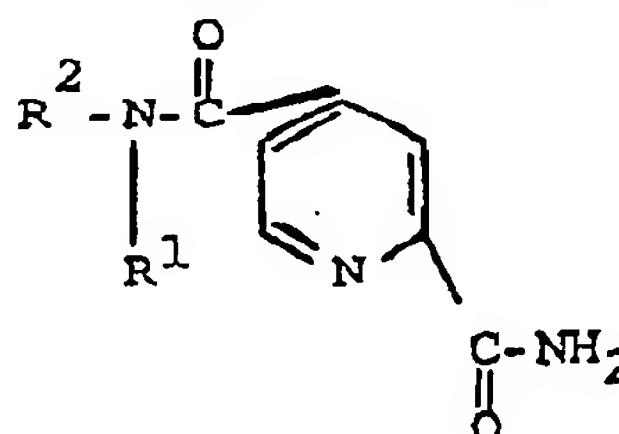
dr. Bläckel, Martin, Bad Homburg, DE

dr. Günzler-Pukall, Volkmar, Marburg, DE

dr. Volz, Manfred, Usingen, DE

Képviselő:

Schläfer László, DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest, HU

**Kivonat:**

A találmány szerinti vegyületek (I) általános képletében R1 jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, hidroxilcsoporttal vagy adott esetben fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoporttal szubsztituált karboxilcsoporttal szubsztituálva lehet, R2 jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, vagy R1 és R2 a kapcsolódó nitrogénatommal együtt morfolinocsoportot képez. A találmány kiterjed a fenti vegyületek előállítására, valamint a fenti vegyületeket tartalmazó gyógyszerkészítményekre és ezek előállítására. A vegyületek kollagénbioszintézist gátló hatásúak.

Igény pont:

1. (I) általános képletű piridin-2,4-dikarbonsav-diimidök és fiziológiailag alkalmazható sóik, a képletben R1 jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, hidroxilcsoporttal vagy adott esetben fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoporttal szubsztituált karboxilcsoporttal szubsztituálva lehet, R2 jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, vagy R1 és R2 a kapcsolódó nitrogénatommal együtt morfolinocsoportot képez.

2. Eljárás (I) általános képletű piridin-2,4-dikarbonsav-diimidök és fiziológiailag alkalmazható sóik előállítására, a képletben R1 jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, hidroxilcsoporttal vagy adott esetben fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoporttal szubsztituált karboxilcsoporttal szubsztituálva lehet, R2 jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, vagy R1 és R2 a kapcsolódó nitrogénatommal együtt morfolinocsoportot képez, azzal jellemzően, hogy egy (IV) általános képletű vegyületet, ahol R1 és R2 jelentése a tárgyi körben megadott, ammóniával reagáltatunk, és a kapott (I) általános képletű vegyületet kívánt esetben fiziológiailag alkalmazható sóvá alakítjuk.

3. Gyógyszerkészítmény, amely (I) általános képletű vegyületet

① P.2

- segédanyagok mellett.
- 4. Az 1. igénypont szerinti vegyületek prolin- és lizin-hidroxiláz gátlására.
- 5. Az 1. igénypont szerinti vegyületek fibroszupresszívaként és immunszupresszívaként történő alkalmazásra.
- 6. Az 1. igénypont szerinti vegyületek kollagén és kollagénszerű anyagok anyagcseréjét befolyásoló eljárásban történő alkalmazásra.
- 7. Az 1. igénypont szerinti vegyületek kollagén és kollagénszerű anyagok anyagcseréjének zavarai kezelésében történő alkalmazásra.
- 8. Eljárás gyógyszerkészítmények előállítására, azzal jellemezve, hogy valamely, a 2. igénypont szerint előállított (!) általános képletű vegyületet és/vagy fisiológiailag alkalmazható sóját, a képletben R1 és R2 jelentése a 2. igénypontban megadott, gyógyszerészeti hordozóanyaggal és adott esetben egyéb gyógyszerészeti segédanyaggal keverünk, és a keveréket gyógyszerkészítménnyé alakítjuk.